

PCT PTO 01 APR 2005

10/520895

## 特許協力条約

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

REC'D 24 SEP 2004

WIPO

PCT

(法第12条、法施行規則第56条)  
[PCT 36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 PCT-A0336	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP03/12477	国際出願日 (日.月.年) 30.09.2003	優先日 (日.月.年) 04.10.2002
国際特許分類 (IPC) Int.Cl' C07H17/02, A61K31/7056, A61P3/04, 3/06, 3/10, 9/10, 9/12, 13/12, 43/00		
出願人 (氏名又は名称) キッセイ薬品工業株式会社		

1. この報告書は、PCT 35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。  
法施行規則第57条 (PCT 36条) の規定に従い送付する。

2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 3 ページからなる。

3. この報告には次の附属物件も添付されている。

a  附属書類は全部で \_\_\_\_\_ ページである。

補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙 (PCT 規則70.16及び実施細則第 607 号参照)

第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙

b  電子媒体は全部で \_\_\_\_\_ (電子媒体の種類、数を示す)。  
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第 802 号参照)

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

第I欄 国際予備審査報告の基礎  
 第II欄 優先権  
 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成  
 第IV欄 発明の單一性の欠如  
 第V欄 PCT 35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明  
 第VI欄 ある種の引用文献  
 第VII欄 国際出願の不備  
 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 27.04.2004	国際予備審査報告を作成した日 03.09.2004
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目 4番 3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 4C 9736 荒木 英則 電話番号 03-3581-1101 内線 3450

## 第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

この報告は、\_\_\_\_\_語による翻訳文を基礎とした。  
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。  
 PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査  
 PCT規則12.4にいう国際公開  
 PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

 出願時の国際出願書類 明細書

第 \_\_\_\_\_ ページ、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

 請求の範囲

第 \_\_\_\_\_ 項、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ 項\*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの  
第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

 図面

第 \_\_\_\_\_ ページ/図、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3.  補正により、下記の書類が削除された。

<input type="checkbox"/> 明細書	第 _____	ページ
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項
<input type="checkbox"/> 図面	第 _____	ページ/図
<input type="checkbox"/> 配列表(具体的に記載すること)	_____	
<input type="checkbox"/> 配列表に関するテーブル(具体的に記載すること)	_____	

4.  この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

<input type="checkbox"/> 明細書	第 _____	ページ
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項
<input type="checkbox"/> 図面	第 _____	ページ/図
<input type="checkbox"/> 配列表(具体的に記載すること)	_____	
<input type="checkbox"/> 配列表に関するテーブル(具体的に記載すること)	_____	

\* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。

## 第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条（PCT35条(2)）に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲 請求の範囲	1 - 2 3	有 無
進歩性 (I S)	請求の範囲 請求の範囲	1 - 2 3	有 無
産業上の利用可能性 (I A)	請求の範囲 請求の範囲	1 - 2 3	有 無

## 2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

見解は、国際調査報告に引用された以下の各文献の記載に基づいて示される。

- 文献1 : WO 02/36602 A1 (味の素株式会社)
- 文献2 : WO 01/16147 A1 (キッセイ薬品工業株式会社)
- 文献3 : WO 02/053573 A1 (キッセイ薬品工業株式会社)
- 文献4 : WO 02/068439 A1 (キッセイ薬品工業株式会社)
- 文献5 : WO 02/068440 A1 (キッセイ薬品工業株式会社)
- 文献6 : WO 01/27128 A1 (BRISTOL MYERS SQUIBB COMPANY)
- 文献7 : WO 02/053738 A1 (キッセイ薬品工業株式会社)
- 文献8 : YAMANOUCHI, T., et al., *Biochim. Biophys. Acta.*, 1996, 1291, pp. 89-95

## ○請求の範囲1-23について

文献1から5には、糖残基で置換されたピラゾール誘導体、該誘導体を有効成分とする糖尿病、糖尿病合併症等の治療剤及びその中間体が記載されている。また、文献6には、アリールグルコシド誘導体及び該誘導体を有効成分とする糖尿病、糖尿病関連疾患の治療剤及びその中間体が記載されている。ここで、請求の範囲1-23に係る発明と文献1から6に係る発明とを比較すると、前者がピラゾール骨格の3位又は5位に置換される置換基が、それぞれ、糖残基又は水酸基、及び、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Ar、アルコキシ基、アミノ基、ヘテロシクロアルキル基又は複素環が縮合したフェニル基であるとされているのに対し、後者のものでは糖残基又は水酸基により置換されていない部分の置換基がアルキル基又はペーフルオロアルキル基であるとされている点で相違する。

そして、この点に関し、文献1から6と同様又は類似の生理活性を有する化合物において、ピラゾール環の対応部位に-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Ar、アルコキシ基、アミノ基、ヘテロシクロアルキル基又は複素環が縮合したフェニル基が置換されたものを発見することはできなかった。また、文献7及び8には、それぞれナトリウム/グルコース共輸送担体活性を有するタンパク質、及び、1,5-アンヒドログルシトール/フルクトース/マンノース輸送担体の存在及び機能について記載されているが、請求の範囲1-23に係る発明に記載の化学構造を有する化合物や該化合物を有効成分とする医薬に関してはこれら記載されていない。してみれば、当業者といえどもこれらの文献の記載から請求の範囲1-23に係る発明に想到し得たものとは言うことができない。

したがって、請求の範囲1-23に係る発明は、文献1から8の記載によつても進歩性を有するものである。

Translation

## PATENT COOPERATION TREATY

## PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY  
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)



Applicant's or agent's file reference  PCT-A0336	<b>FOR FURTHER ACTION</b>		See Form PCT/IPEA/416
International application No.  PCT/JP2003/012477	International filing date ( <i>day/month/year</i> )  30 September 2003 (30.09.2003)	Priority date ( <i>day/month/year</i> )  04 October 2002 (04.10.2002)	
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07H 17/02, A61K 31/7056, A61P 3/04, 3/06, 3/10, 9/10, 9/12, 13/12, 43/00			
Applicant  KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.			

<p>1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.</p> <p>2. This REPORT consists of a total of <u>4</u> sheets, including this cover sheet.</p> <p>3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:</p> <p>a. <input type="checkbox"/> (<i>sent to the applicant and to the International Bureau</i>) a total of _____ sheets, as follows:</p> <p><input type="checkbox"/> sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).</p> <p><input type="checkbox"/> sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (<i>sent to the International Bureau only</i>) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) _____, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).</p> <p>4. This report contains indications relating to the following items:</p> <ul style="list-style-type: none"> <li><input checked="" type="checkbox"/> Box No. I Basis of the report</li> <li><input type="checkbox"/> Box No. II Priority</li> <li><input type="checkbox"/> Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</li> <li><input type="checkbox"/> Box No. IV Lack of unity of invention</li> <li><input checked="" type="checkbox"/> Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement</li> <li><input type="checkbox"/> Box No. VI Certain documents cited</li> <li><input type="checkbox"/> Box No. VII Certain defects in the international application</li> <li><input type="checkbox"/> Box No. VIII Certain observations on the international application</li> </ul>
---

Date of submission of the demand  27 April 2004 (27.04.2004)	Date of completion of this report  03 September 2004 (03.09.2004)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2003/012477

## Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

This report is based on translations from the original language into the following language \_\_\_\_\_, which is language of a translation furnished for the purpose of:

- international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
- publication of the international application (under Rule 12.4)
- international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on (*replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report*):

The international application as originally filed/furnished

the description:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

the claims:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement) under Article 19

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

the drawings:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3.  The amendments have resulted in the cancellation of:

- the description, pages \_\_\_\_\_
- the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_
- any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

4.  This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

- the description, pages \_\_\_\_\_
- the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_
- any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

\* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.  
PCT/JP 03/12477

## V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

## 1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-23	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims	1-23	YES
	Claims		NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-23	YES
	Claims		NO

## 2. Citations and explanations

The present written opinion was drafted on the basis of the disclosures of the following documents, which are cited in the international search report.

Document 1: WO 02/36602 A1 (Ajinomoto Co., Inc.)  
 Document 2: WO 01/16147 A1 (Kissei Pharm. Co., Ltd.)  
 Document 3: WO 02/053573 A1 (Kissei Pharm. Co., Ltd.)  
 Document 4: WO 02/068439 A1 (Kissei Pharm. Co., Ltd.)  
 Document 5: WO 02/068440 A1 (Kissei Pharm. Co., Ltd.)  
 Document 6: WO 01/27128 A1 (Bristol Myers Squibb Co.)  
 Document 7: WO 02/053738 A1 (Kissei Pharm. Co., Ltd.)  
 Document 8: T. YAMANOUCHI et al., Biochim. Biophys. Acta., 1996, 1291, pp. 89-95

Claims 1 to 23

Documents 1 to 5 disclose sugar residue-substituted pyrazole derivatives; therapeutic drugs against diabetes, the complications arising from diabetes and the like, which comprise said derivatives; and intermediates thereof. In addition, document 6 discloses aryl glucoside derivatives; therapeutic drugs against diabetes, the complications arising from diabetes and the like, which comprise said derivatives; and intermediates thereof.

Therein, a comparison of the inventions that are set forth

in claims 1 to 23 and the inventions that are disclosed in documents 1 to 6 shows that in the former inventions, the substituent group that is substituted into the 3 position or the 5 position of the pyrazole skeleton is a phenyl group to which a sugar residue group or a hydroxy group and a  $-(CH_2)_n-Ar$  group, an alkoxy group, an amino group, a heterocyclic alkyl group or a heterocyclic ring has been bonded via condensation, whereas in the latter inventions, the substituent groups for the portions that have not been substituted with a sugar residue group or a hydroxy group are alkyl groups or perfluoroalkyl groups; therefore, the inventions in question are different.

With regards to the feature in question, it was impossible to discover any compounds among the compounds exhibiting a physiological activity that is identical or similar to that which is disclosed in documents 1 to 6 wherein a phenyl group to which a  $-(CH_2)_n-Ar$  group, an alkoxy group, an amino group, a heterocyclic alkyl group or a heterocyclic ring has been bonded via condensation is substituted into the corresponding positions of the pyrazole ring. Furthermore, documents 7 and 8 disclose proteins that exhibit a sodium/glucose transporting activity, and indicate the presence and functions of 1, 5-anhydroglucitol/fructose/mannose transporters; however, documents 7 and 8 do not make any disclosures pertaining to compounds that have the chemical structures from the inventions that are set forth in claims 1 to 23, or to medicaments that comprise said compounds as active components. Therefore, it cannot be said to be easy for even a person skilled in the art to conceive of the inventions that are set forth in claims 1 to 23 in the light of the disclosures of documents 1 to 8.

Consequently, the inventions that are set forth in claims 1 to 23 involve an inventive step in relation to the disclosures of documents 1 to 8.